

医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会の IF 記載要領 2018(2019 年更新版)に準拠して作成

抗アレルギー点眼剤

オロパタジン塩酸塩点眼液

オロパタジン点眼液0.1%「杏林」

OLOPATADINE Ophthalmic Solution

剤形	水性点眼剤
製剤の規制区分	該当しない
規格・含量	1mL 中、オロパタジンとして 1mg（日局オロパタジン塩酸塩 1.1mg）
一般名	和名：オロパタジン塩酸塩（JAN） 洋名：Olopatadine Hydrochloride（JAN）
製造販売承認年月日 薬価基準収載・販売開始年月日	製造販売承認年月日：2021 年 8 月 16 日 薬価基準収載年月日：2021 年 12 月 10 日 販売開始年月日：2021 年 12 月 10 日
製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：キョーリンリメディオ株式会社 販売元：杏林製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	キョーリン リメディオ株式会社 学術部 TEL：0120-960189 FAX：0120-189099 受付時間：平日 9:00～17:00（弊社休業日を除く） 医療関係者向けホームページ https://www.med.kyorin-rmd.com/

本 IF は 2024 年 5 月改訂の電子添文の記載に基づき改訂した。

最新の情報は、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構の医薬品情報検索ページで確認してください。



(01)14987060305678

1. 医薬品インタビューフォーム作成の経緯

医療用医薬品の基本的な要約情報として、医療用医薬品添付文書（以下、添付文書）がある。医療現場で医師・薬剤師等の医療従事者が日常業務に必要な医薬品の適正使用情報を活用する際には、添付文書に記載された情報を裏付ける更に詳細な情報が必要な場合があり、製薬企業の医薬情報担当者（以下、MR）等への情報の追加請求や質疑により情報を補完してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための項目リストとして医薬品インタビューフォーム（以下、I Fと略す）が誕生した。

1988 年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬）学術第 2 小委員会が I F の位置付け、I F 記載様式、I F 記載要領を策定し、その後 1998 年に日病薬学術第 3 小委員会が、2008 年、2013 年に日病薬医薬情報委員会が I F 記載要領の改訂を行ってきた。

I F 記載要領 2008 以降、I F は P D F 等の電子的データとして提供することが原則となった。これにより、添付文書の主要な改訂があった場合に改訂の根拠データを追加した I F が速やかに提供されることとなった。最新版の I F は、医薬品医療機器総合機構（以下、PMD A）の医療用医薬品情報検索のページ（<http://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/>）にて公開されている。日病薬では、2009 年より新医薬品の I F の情報を検討する組織として「インタビューフォーム検討会」を設置し、個々の I F が添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討している。

2019 年の添付文書記載要領の変更に合わせ、I F 記載要領 2018 が公表され、今般「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン」に関連する情報整備のため、その更新版を策定した。

2. I F とは

I F は「添付文書等の情報を補完し、医師・薬剤師等の医療従事者にとって日常業務に必要な、医薬品の品質管理のための情報、処方設計のための情報、調剤のための情報、医薬品の適正使用のための情報、薬学的な患者ケアのための情報等が集約された総合的な個別の医薬品解説書として、日病薬が記載要領を策定し、薬剤師等のために当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業に作成及び提供を依頼している学術資料」と位置付けられる。

I F に記載する項目配列は日病薬が策定した I F 記載要領に準拠し、一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される。ただし、製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・判断・提供すべき事項等は I F の記載事項とはならない。言い換えると、製薬企業から提供された I F は、利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに、必要な補完をするものという認識を持つことを前提としている。

I F の提供は電子データを基本とし、製薬企業での製本は必須ではない。

3. I F の利用にあたって

電子媒体の I F は、PMD A の医療用医薬品情報検索のページに掲載場所が設定されている。

製薬企業は「医薬品インタビューフォーム作成の手引き」に従って I F を作成・提供するが、I F の原点を踏まえ、医療現場に不足している情報や I F 作成時に記載し難い情報等については製薬企業の M R 等へのインタビューにより利用者自らが内容を充実させ、I F の利用性を高める必要がある。また、随時改訂される使用上の注意等に関する事項に関しては、I F が改訂されるまでの間は、製薬企業が提供する改訂内容を明らかにした文書等、あるいは各種の医薬品情報提供サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、I F の使用にあたっては、最新の添付文書を PMD A の医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「V. 5. 臨床成績」や「XII. 参考資料」、「XIII. 備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり、その取り扱いには十分留意すべきである。

4. 利用に際しての留意点

I F を日常業務において欠かすことができない医薬品情報源として活用していただきたい。I F は日

病薬の要請を受けて、当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業が作成・提供する、医薬品適正使用のための学術資料であるとの位置づけだが、記載・表現には薬機法の広告規則や医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン、製薬協コード・オブ・プラクティス等の制約を一定程度受けざるを得ない。販売情報提供活動ガイドラインでは、未承認薬や承認外の用法等に関する情報提供について、製薬企業が医療従事者からの求めに応じて行うことは差し支えないとされており、MR等へのインタビューや自らの文献調査などにより、利用者自らがI Fの内容を充実させるべきものであることを認識しておかなければならない。製薬企業から得られる情報の科学的根拠を確認し、その客観性を見抜き、医療現場における適正使用を確保することは薬剤師の本務であり、I Fを活用して日常業務を更に価値あるものにしていただきたい。

目 次

I. 概要に関する項目	1	9. 透析等による除去率	14
1. 開発の経緯	1	10. 特定の背景を有する患者	14
2. 製品の治療学的特性	1	11. その他	14
3. 製品の製剤学的特性	1		
4. 適正使用に関して周知すべき特性	1	VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目	15
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	1	1. 警告内容とその理由	15
6. RMP の概要	1	2. 禁忌内容とその理由	15
		3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	15
II. 名称に関する項目	2	4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	15
1. 販売名	2	5. 重要な基本的注意とその理由	15
2. 一般名	2	6. 特定の背景を有する患者に関する注意	15
3. 構造式又は示性式	2	7. 相互作用	16
4. 分子式及び分子量	2	8. 副作用	16
5. 化学名(命名法)又は本質	2	9. 臨床検査結果に及ぼす影響	17
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2	10. 過量投与	17
		11. 適用上の注意	17
III. 有効成分に関する項目	3	12. その他の注意	17
1. 物理化学的性質	3		
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3	IX. 非臨床試験に関する項目	18
3. 有効成分の確認試験法、定量法	3	1. 薬理試験	18
		2. 毒性試験	18
IV. 製剤に関する項目	4		
1. 剤形	4	X. 管理的事項に関する項目	19
2. 製剤の組成	4	1. 規制区分	19
3. 添付溶解液の組成及び容量	4	2. 有効期間	19
4. 力価	4	3. 包装状態での貯法	19
5. 混入する可能性のある夾雑物	4	4. 取扱い上の注意	19
6. 製剤の各種条件下における安定性	5	5. 患者向け資材	19
7. 調製法及び溶解後の安定性	6	6. 同一成分・同効薬	19
8. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	6	7. 国際誕生年月日	19
9. 溶出性	6	8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日	19
10. 容器・包装	6	9. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容	19
11. 別途提供される資材類	7	10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	19
12. その他	7	11. 再審査期間	20
		12. 投薬期間制限に関する情報	20
V. 治療に関する項目	8	13. 各種コード	20
1. 効能又は効果	8	14. 保険給付上の注意	20
2. 効能又は効果に関連する注意	8		
3. 用法及び用量	8	XI. 文献	21
4. 用法及び用量に関連する注意	8	1. 引用文献	21
5. 臨床成績	8	2. その他の参考文献	21
VI. 薬効薬理に関する項目	11	XII. 参考資料	22
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	11	1. 主な外国での発売状況	22
2. 薬理作用	11	2. 海外における臨床支援情報	22
VII. 薬物動態に関する項目	12	XIII. 備考	23
1. 血中濃度の推移	12	1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報	23
2. 薬物速度論的パラメータ	12	2. その他の関連資料	23
3. 母集団(ポピュレーション)解析	13		
4. 吸収	13		
5. 分布	13		
6. 代謝	13		
7. 排泄	13		
8. トランスポーターに関する情報	13		

略 語 表

略語	略語内容
ALT	アラニンアミノトランスフェラーゼ
AST	アスパラギン酸アミノトランスフェラーゼ
AUC	血中濃度-時間曲線下面積
C _{max}	最高血中濃度
ED ₅₀	50%有効量
IC ₅₀	50%阻害濃度
K _i	阻害定数
NOS	not otherwise specified
T _{max}	最高血中濃度到達時間

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

オロパタジン点眼液 0.1%「杏林」は、後発医薬品として薬食発 1121 第 2 号(平成 26 年 11 月 21 日)に基づき、規格及び試験方法を設定、安定性試験を行い承認申請し、2021 年 8 月に承認を取得、2021 年 12 月に薬価収載した。また、本剤は標準製剤の分析結果に基づき添加剤の種類及び含量(濃度)が標準製剤と同一となるよう処方設計を行ったものであり、pH、粘度、浸透圧などの物理化学的性質が近似することから、生物学的に同等とみなされた。

なお、本剤は、後発医薬品として、キョーリン リメディオ株式会社、株式会社三和化学研究所、高田製薬株式会社の 3 社で共同開発を実施し、共同開発グループとして実施したデータを共有し、承認を得て上市に至った。

2. 製品の治療学的特性

- 本剤は抗アレルギー点眼剤であり、アレルギー性結膜炎の効能又は効果を有している。
(「V. 1. 効能又は効果」の項参照)

- 副作用として、眼痛、角膜炎、そう痒症、眼刺激、眼瞼浮腫、眼の異常感、充血、眼瞼炎、眼脂、結膜濾胞、結膜出血、眼瞼湿疹、眼瞼紅斑、流涙増加、眼の異物感、眼部不快感、眼瞼障害、眼乾燥、眼瞼縁痂皮、霧視、眼瞼痛、頭痛、味覚異常、めまい、ALT 上昇、AST 上昇、ヘマトクリット減少、尿中ブドウ糖陽性、接触性皮膚炎、口内乾燥、悪心、過敏症、咽喉乾燥がある。

(「VIII. 8. (2) その他の副作用」の項参照)

3. 製品の製剤学的特性

特になし

4. 適正使用に関して周知すべき特性

適正使用に関する資料、最適使用推進ガイドライン等	有無
RMP	無
追加のリスク最小化活動として作成されている資料	無
最適使用推進ガイドライン	無
保険適用上の留意事項通知	無

5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項

(1) 承認条件

該当しない

(2) 流通・使用上の制限事項

該当しない

6. RMP の概要

該当しない

Ⅱ. 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名

オロパタジン点眼液 0.1% 「杏林」

(2) 洋名

OLOPATADINE Ophthalmic Solution 0.1% “KYORIN”

(3) 名称の由来

「一般的名称」 + 「剤形」 + 「含量」 + 「屋号」

〔「医療用後発医薬品の承認申請にあたっての販売名の命名に関する留意事項について」(平成 17 年 9 月 22 日 薬食審査発第 0922001 号)に基づく〕

2. 一般名

(1) 和名 (命名法)

オロパタジン塩酸塩 (JAN)

(2) 洋名 (命名法)

Olopatadine Hydrochloride (JAN)

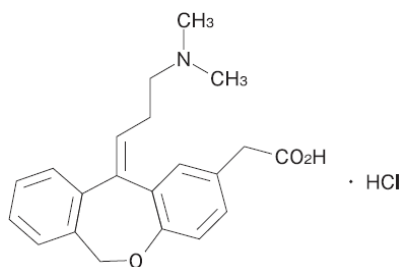
Olopatadine (INN)

(3) ステム

三環系 H_1 受容体拮抗薬: -tadine

3. 構造式又は示性式

化学構造式:



4. 分子式及び分子量

分子式: $\text{C}_{21}\text{H}_{23}\text{NO}_3 \cdot \text{HCl}$

分子量: 373.87

5. 化学名 (命名法) 又は本質

化学名: {11-[(1Z)-3-(Dimethylamino)propylidene]-6, 11-dihydrodibenzo[*b, e*]oxepin-2-yl}acetic acid monohydrochloride (IUPAC)

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

特になし

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

白色の結晶又は結晶性の粉末である。

(2) 溶解性

ギ酸に極めて溶けやすく、水にやや溶けにくく、エタノール(99.5)に極めて溶けにくい。
0.01mol/L 塩酸試液に溶ける。

(3) 吸湿性

該当資料なし

(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

融点：約 250℃（分解）

(5) 酸塩基解離定数

該当資料なし

(6) 分配係数

該当資料なし

(7) その他の主な示性値

pH：1.0g を水 100mL に溶かした液の pH は 2.3～3.3 である。

2. 有効成分の各種条件下における安定性

該当資料なし

3. 有効成分の確認試験法、定量法

● 確認試験法

日本薬局方「オロパタジン塩酸塩」の確認試験による。

- (1) 紫外可視吸光度測定法
- (2) 赤外吸収スペクトル測定法（塩化カリウム錠剤法）
- (3) 塩化物の定性反応(2)

● 定量法

日本薬局方「オロパタジン塩酸塩」の定量法による。

電位差滴定法

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別

点眼剤

(2) 製剤の外観及び性状

性状	無色～微黄色澄明、無菌水性点眼剤
----	------------------

(3) 識別コード

識別コード	KRM007
記載場所	容器ラベル

(4) 製剤の物性

pH	6.8～7.2
浸透圧比	0.9～1.1（生理食塩液に対する比）

(5) その他

該当資料なし

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量および添加剤

有効成分（1mL 中）	オロパタジンとして 1mg（日局オロパタジン塩酸塩 1.1mg）
添加剤	リン酸水素ナトリウム水和物、ベンザルコニウム塩化物、等張化剤、pH 調節剤

(2) 電解質等の濃度

該当しない

(3) 熱量

該当しない

3. 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

4. 力価

該当しない

5. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

6. 製剤の各種条件下における安定性

1) 加速試験¹⁾

[保存条件]

40℃±1℃、75%RH±5%RH

[試験検体]

容器(ポリプロピレン製チヌビン 0.05%入り)、中栓(ポリエチレン製)、キャップ(ポリプロピレン製)、紙箱

[試験項目及び規格]

試験項目	規 格
性状	無色～微黄色澄明の水溶性点眼液
確認試験	紫外可視吸光度測定法:波長 295～299nm に吸収の極大を示す。
pH	6.8～7.2
浸透圧比	0.9～1.1
純度試験	個々の類縁物質:0.5%以下 類縁物質の合計:1.0%以下
不溶性異物	澄明で、たやすく検出される不溶性異物を認めない。
不溶性微粒子	1mL 中の個数に換算するとき、300μm 以上の不溶性微粒子が 1 個以下。
無菌	微生物の増殖が観察されない。
定量法	含量:95.0～105.0%

[結果]

試験項目	開始時	1 ヶ月	3 ヶ月	6 ヶ月
性状	適	適	適	適
確認試験	適	適	適	適
pH [*]	7.04	7.03	7.03	7.04
浸透圧比 [*]	1.0	1.0	1.0	1.0
純度試験	適	適	適	適
不溶性異物	適	適	適	適
不溶性微粒子	適	適	適	適
無菌	(-)			(-)
定量法(含量) [*]	99.9%	99.7%	99.4%	100.1%

(-) : 菌の発育を認めず ※1 ロット n=3 の 3 ロットの平均値

2) 長期保存試験²⁾

[保存条件]

25℃±2℃、60%RH±5%RH

[試験検体][試験項目及び規格]

加速試験 参照

[結果]

試験項目	開始時	0.5 年	1 年	2 年	3 年
性状	適	適	適	適	適
確認試験	適				適
pH [*]	7.15	7.08	7.05	7.02	7.03
浸透圧比 [*]	1.00				1.04
純度試験	適	適	適	適	適
不溶性異物	適		適	適	適
不溶性微粒子	適		適	適	適
無菌	(-)				(-)
定量法(含量) ^{**}	99.4%	99.7%	100.9%	101.8%	101.9%

(-) : 菌の発育を認めず ※1 ロット n=1 の 3 ロットの平均値 ※※1 ロット n=3 の 3 ロットの平均値

3) 光安定性試験³⁾

[保存条件]

- ①25℃±2℃、60%RH±5%RH（暗所）
- ②25℃±2℃、60%RH±5%RH、1000lx（曝光）

[試験検体]

容器(ポリプロピレン製チヌビン 0.05%入り)、中栓(ポリエチレン製)、キャップ(ポリプロピレン製)

[試験項目及び規格]

試験項目	規 格
性状	無色～微黄色澄明の水溶性点眼液
純度試験	個々の類縁物質：0.5%以下 類縁物質の合計：1.0%以下
定量法	含量：95.0～105.0%

[結果]

試験項目	開始時	①暗所保存	②曝光（1000lx 照射）	
		50 日	25 日 (60 万 lx・hr)	50 日 (120 万 lx・hr)
性状	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
純度試験	適	適	適	適
定量法(含量)	100.7%	100.4%	99.7%	100.8%

(n=1)

本剤の安定性に関する結果であり、有効性・安全性についての評価は実施しておりません。

7. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

8. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

「XⅢ. 2. その他の関連資料」の項参照

9. 溶出性

該当しない

10. 容器・包装

(1) 注意が必要な容器・包装、外観が特殊な容器・包装に関する情報

該当しない

(2) 包装

プラスチック点眼容器 5mL×10 本（投薬袋 10 枚同梱）

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

本体：ポリプロピレン(PP)

中栓：ポリエチレン(PE)

キャップ：ポリプロピレン(PP)

シュリンクラベル：ポリエチレンテレフタレート(PET)

11. 別途提供される資材類

該当しない

12. その他

1 滴容量（1 滴の質量を比重換算して 1 滴容量を算出）⁴⁾

試験回数	1 滴容量（10 滴の平均値）
1 回目	32.4 μ L
2 回目	31.5 μ L
3 回目	32.4 μ L

本試験は参考であり、1 滴容量を保証するものではありません。

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

4.効能又は効果

アレルギー性結膜炎

2. 効能又は効果に関連する注意

設定されていない

3. 用法及び用量

(1) 用法及び用量の解説

6.用法及び用量

通常、1回1～2滴、1日4回（朝、昼、夕方及び就寝前）点眼する。

(2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし

4. 用法及び用量に関連する注意

設定されていない

5. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

(2) 臨床薬理試験

該当資料なし

(3) 用量反応探索試験

該当資料なし

(4) 検証的試験

1) 有効性検証試験

17.臨床成績

17.1 有効性及び安全性に関する試験

17.1.1 海外後期第Ⅱ相試験（抗原誘発試験）

無症状期の日本人アレルギー性結膜炎患者（147 例）を対象に海外で実施した後期第Ⅱ相試験において、片眼にオロパタジン点眼液（0.01%群 38 例、0.05%群 38 例、0.1%群 35 例、0.15%群 36 例）、対眼にプラセボをそれぞれ 1 回 1 滴点眼し、点眼 4 時間後に抗原誘発を行った。抗原誘発 5 分後におけるそう痒感の平均スコアの 0.1% オロパタジン点眼液群とプラセボ群との差と 95%信頼区間は、 -1.19 、 $[-1.52, -0.85]$ であり、抗原誘発 20 分後における総合充血の平均スコアの 0.1%オロパタジン点眼液群とプラセボ群との差と 95%信頼区間は、 -0.93 、 $[-1.49, -0.37]$ であった。

0.1%オロパタジン点眼液投与群 35 例（安全評価対象例）で副作用は認められなかった⁵⁾。

17.1.2 国内第Ⅲ相比較試験（ケチフェンフマル酸塩点眼液を対照薬とした二重盲検並行群間比較試験）

アレルギー性結膜炎患者（247 例）を対象に、0.1%オロパタジン点眼液又は 0.05%ケチフェンフマル酸塩点眼液を両眼に 1 回 2 滴、1 日 4 回（朝、昼、夕、就寝前）28 日間点眼投与したところ、そう痒感及び充血の重症度点数において、0.1%オロパタジン点眼液は 0.05%ケチフェンフマル酸塩点眼液に劣らない有効性を示した。

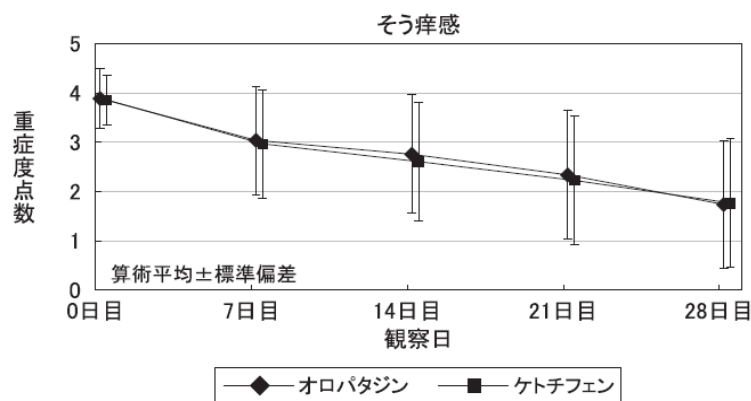


図 17-1 そう痒感の推移

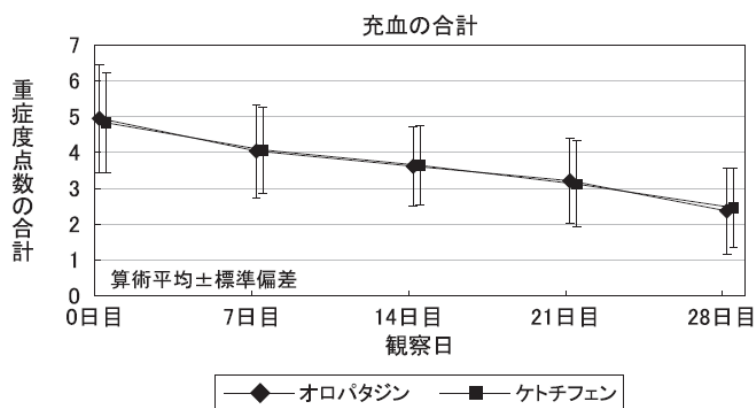


図 17-2 充血の合計の推移

副作用発現頻度は、0.1%オロパタジン点眼液投与群で 4.8%（6/124 例）であった。副作用は眼痛 2.4%（3/124 例）、角膜炎 NOS 0.8%（1/124 例）、アラニン・アミノトランスフェラーゼ増加 1.6%（2/124 例）、アスパラギン酸アミノトランスフェラーゼ増加 0.8%（1/124 例）であった⁶⁾。

2) 安全性試験

該当資料なし

(5) 患者・病態別試験

該当資料なし

(6) 治療的使用

- 1) 使用成績調査（一般使用成績調査、特定使用成績調査、使用成績比較調査）、製造販売後データベース調査、製造販売後臨床試験の内容

該当資料なし

- 2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した調査・試験の概要

該当資料なし

(7) その他

該当資料なし

VI. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群

ヒスタミン H_1 受容体拮抗薬：

エバスタチン、エピナスチン塩酸塩、ケトチフェンフマル酸塩、セチリジン塩酸塩、デスロラタジン、ビラスチン、フェキソフェナジン塩酸塩、ベタボスチンベシル酸塩、レボセチリジン塩酸塩、ロラタジン など

注意：関連のある化合物の効能・効果等は、最新の電子添文を参照すること。

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

18.1 作用機序

オロパタジン塩酸塩は、選択的ヒスタミン H_1 受容体拮抗作用を主作用とし、更に肥満細胞からの化学伝達物質の遊離・産生抑制作用を有する⁷⁾。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

18.2 抗ヒスタミン作用 (*in vitro*)

受容体結合実験において、ヒスタミン H_1 受容体に強い拮抗作用 (K_i 値：41～59nmol/L) を有し、その作用は選択的である。

ヒスタミン刺激によるヒト結膜上皮細胞からのインターロイキン-6 (IC_{50} 値：5.5nmol/L) 及びインターロイキン-8 (IC_{50} 値：1.7nmol/L) の遊離・産生を抑制した^{8)～10)}。

18.3 抗アレルギー作用 (*in vitro*)

抗ヒト IgE 抗体刺激によるヒト結膜肥満細胞からのヒスタミン (IC_{50} 値：314～859 μ mol/L)、トリプターゼ、プロスタグランジン D_2 (IC_{50} 値：736 μ mol/L) 及び TNF α (IC_{50} 値：13.1 μ mol/L) の遊離・産生を抑制した^{11)、12)}。

18.4 動物結膜炎モデルにおける作用

ヒスタミン誘発によるモルモット結膜における血管透過性亢進を抑制 (ED_{50} 値：0.002%) した。感作モルモットの抗原誘発による眼瞼と眼球結膜の充血及び膨疹を抑制 (ED_{50} 値：0.017%) した¹³⁾。

(3) 作用発現時間・持続時間

該当資料なし

VII. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移

(1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

(2) 臨床試験で確認された血中濃度

16.1 血中濃度

16.1.1 反復投与

アレルギー患者（12例）に0.1%オロパタジン点眼液を、両眼に1回2滴、6時間ごとに（1日4回点眼）4日間反復点眼したときのオロパタジン（未変化体）の薬物動態パラメータは下記のとおりであった¹⁴⁾。

表 16-1 オロパタジン（未変化体）の薬物動態パラメータ

点眼日	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (hr)	AUC ₀₋₆ (ng・hr/mL)	消失半減期 (hr)
3日目	0.610±0.518	1.21±0.62	2.07±1.46	算出できず
4日目	0.520±0.416	1.23±0.62	1.90±1.16 ^{※2}	3.1±1.3
検定 ^{※1} (Paired t test)	p=0.0814	検定せず	p=0.1249	検定せず

（平均値±標準偏差 n=12）

※1：3日目と4日目の比較

※2：n=11

(3) 中毒域

該当資料なし

(4) 食事・併用薬の影響

該当資料なし

2. 薬物速度論的パラメータ

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) 吸収速度定数

該当資料なし

(3) 消失速度定数

該当資料なし

(4) クリアランス

該当資料なし

(5) 分布容積

該当資料なし

(6) その他

該当資料なし

3. 母集団（ポピュレーション）解析

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) パラメータ変動要因

該当資料なし

4. 吸収

該当資料なし

5. 分布

(1) 血液－脳関門通過性

該当資料なし

(2) 血液－胎盤関門通過性

該当資料なし

(3) 乳汁への移行性

「Ⅷ. 6. (6) 授乳婦」の項参照

(4) 髄液への移行性

該当資料なし

(5) その他の組織への移行性

該当資料なし

(6) 血漿蛋白結合率

該当資料なし

6. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

該当資料なし

(2) 代謝に関与する酵素（CYP 等）の分子種、寄与率

該当資料なし

(3) 初回通過効果の有無及びその割合

該当資料なし

(4) 代謝物の活性の有無及び活性比、存在比率

該当資料なし

7. 排泄

該当資料なし

8. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

9. 透析等による除去率

該当資料なし

10. 特定の背景を有する患者

該当資料なし

11. その他

16.8 その他

16.8.1 生物学的同等性試験

オロパタジン点眼液 0.1%「杏林」は、パタノール点眼液 0.1%の分析結果に基づき添加剤の種類及び含量（濃度）がパタノール点眼液 0.1%と同一となるよう処方設計を行ったものであり、pH、粘度、浸透圧などの物理化学的性質が近似することから、生物学的に同等とみなされた。

VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

1. 警告内容とその理由

設定されていない

2. 禁忌内容とその理由

2.禁忌（次の患者には投与しないこと）

2.1 本剤の成分に対して過敏症の既往歴のある患者

3. 効能又は効果に関連する注意とその理由

設定されていない

4. 用法及び用量に関連する注意とその理由

設定されていない

5. 重要な基本的注意とその理由

8.重要な基本的注意

8.1 本剤の使用により効果が認められない場合には、漫然と長期にわたり投与しないよう注意すること。

6. 特定の背景を有する患者に関する注意

(1) 合併症・既往歴等のある患者

設定されていない

(2) 腎機能障害患者

設定されていない

(3) 肝機能障害患者

設定されていない

(4) 生殖能を有する者

設定されていない

(5) 妊婦

9.5 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある女性には、治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合にのみ投与すること。

(6) 授乳婦

9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。動物実験（ラット、経口）で乳汁中への移行及び出生児の体重増加抑制が報告されている。

(7) 小児等

9.7 小児等

低出生体重児、新生児、乳児を対象とした臨床試験は実施していない。

(8) 高齢者

設定されていない

7. 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由

設定されていない

(2) 併用注意とその理由

設定されていない

8. 副作用

11. 副作用

次の副作用があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

(1) 重大な副作用と初期症状

設定されていない

(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用

	0.5～5%未満	0.5%未満	頻度不明
眼	眼痛	角膜炎、そう痒症、眼刺激、眼瞼浮腫、目の異常感、充血、眼瞼炎、眼脂、結膜濾胞、結膜出血、眼瞼湿疹、眼瞼紅斑、流涙増加、目の異物感、眼部不快感、眼瞼障害	眼乾燥、眼瞼縁痂皮、霧視、眼瞼痛
精神神経系		頭痛	味覚異常、めまい
肝臓		ALT 上昇、AST 上昇	
その他		ヘマトクリット減少、尿中ブドウ糖陽性	接触性皮膚炎、口内乾燥、悪心、過敏症、咽喉乾燥

注）使用成績調査及び特定使用成績調査を含む。

9. 臨床検査結果に及ぼす影響

設定されていない

10. 過量投与

設定されていない

11. 適用上の注意

14.適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

患者に対し以下の点に注意するよう指導すること。

- ・薬液汚染防止のため、点眼のとき、容器の先端が直接目に触れないように注意すること。
- ・患眼を開瞼して結膜嚢内に点眼し、1～5 分間閉瞼して涙嚢部を圧迫させた後、開瞼すること。
- ・他の点眼剤を併用する場合には、少なくとも 5 分以上間隔をあけてから点眼すること。
- ・本剤に含まれているベンザルコニウム塩化物は、ソフトコンタクトレンズに吸着されることがあるので、点眼時はコンタクトレンズをはずし、10 分以上経過後装用すること^{15)、16)}。

12. その他の注意

(1) 臨床使用に基づく情報

設定されていない

(2) 非臨床試験に基づく情報

設定されていない

Ⅸ. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験

(1) 薬効薬理試験

「Ⅵ. 薬効薬理に関する項目」の項参照

(2) 安全性薬理試験

該当資料なし

(3) その他の薬理試験

該当資料なし

2. 毒性試験

(1) 単回投与毒性試験

該当資料なし

(2) 反復投与毒性試験

該当資料なし

(3) 遺伝毒性試験

該当資料なし

(4) がん原性試験

該当資料なし

(5) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

(6) 局所刺激性試験

眼粘膜刺激性試験¹⁷⁾

雄性ウサギ(n=6)の右眼眼球角膜上にオロパタジン点眼液 0.1%「杏林」を、左眼眼球角膜上に陰性対照物質として生理食塩液をそれぞれ1回につき100 μ L、30分間隔で8回投与を7日間行った。投与日1日の1回目投与前及び最終投与(8回目投与)後1時間、投与日4日及び7日の1回目投与前、投与日7日の最終投与後1、24、48、72、96及び168時間に角膜、虹彩及び結膜について、生理食塩液投与の左眼と比較し、肉眼的に観察した。発現した反応の程度をDraizeの判定基準により判定した結果、観察期間を通じて眼粘膜刺激性は全く認められず、オロパタジン点眼液0.1%「杏林」は無刺激物であると評価された。

(7) その他の特殊毒性

該当資料なし

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分

製 剤：オロパタジン点眼液 0.1%「杏林」 該当しない
有効成分：オロパタジン塩酸塩 該当しない

2. 有効期間

有効期間：3年

3. 包装状態での貯法

室温保存

4. 取扱い上の注意

20.取扱い上の注意

外箱開封後は、遮光して保存すること。

5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド：なし
くすりのしおり：あり

6. 同一成分・同効薬

同一成分薬：パタノール点眼液 0.1%
同 効 薬：アシタザノラスト水和物、アンレキサノクス、イブジラスト、エピナスチン塩酸塩、クロモグリク酸ナトリウム、ケトチフェンフマル酸塩、トラニラスト、ペミロラストカリウム、レボカバスチン塩酸塩

7. 国際誕生年月日

1996年12月18日

8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日

販売名	製造販売承認年月日	承認番号	薬価基準収載年月日	販売開始年月日
オロパタジン点眼液 0.1%「杏林」	2021年8月16日	30300AMX00318000	2021年12月10日	2021年12月10日

9. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容

該当しない

10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

該当しない

11. 再審査期間

該当しない

12. 投薬期間制限に関する情報

本剤は、投薬期間に関する制限は定められていない。

13. 各種コード

販売名	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	個別医薬品コード (YJコード)	HOT（9桁）番号	レセプト電算処理 システム用コード
オロパタジン点眼液 0.1%「杏林」	1319752Q1040	1319752Q1040	128808701	622880801

14. 保険給付上の注意

本剤は診療報酬上の後発医薬品である。

XI. 文献

1. 引用文献

- 1) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：
オロパタジン点眼液 0.1%「杏林」の安定性試験に関する資料（加速試験）
- 2) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：
オロパタジン点眼液 0.1%「杏林」の安定性試験に関する資料（長期保存試験）
- 3) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：
オロパタジン点眼液 0.1%「杏林」の安定性試験に関する資料（光安定性試験）
- 4) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：
オロパタジン点眼液 0.1%「杏林」の1滴容量に関する資料
- 5) 後期第Ⅱ相試験（抗原誘発試験 2）（パタノール点眼液：2006 年 7 月 26 日承認、申請資料概要ト-1(10)）
- 6) 第Ⅲ相試験 1-フマル酸ケトチフェン点眼液との比較-（C-06-53 試験）（パタノール点眼液：2006 年 7 月 26 日承認、申請資料概要ト-1(8)）
- 7) 第十八改正日本薬局方解説書 廣川書店. 2021 : C-1276-C-1280
- 8) Sharif NA, et al. : J.Ocul.Pharmacol.Ther. 1996 ; 12(4) :401-407
- 9) 作用機序（ヒスタミン受容体拮抗作用）（パタノール点眼液：2006 年 7 月 26 日承認、申請資料概要ホ-3）
- 10) Yanni JM, et al. : Arch.Ophthalmol. 1999 ; 117(5) :643-647
- 11) 作用機序（ヒト結膜肥満細胞からの炎症性伝達物質遊離へ及ぼす影響）（パタノール点眼液：2006 年 7 月 26 日承認、申請資料概要ホ-2）
- 12) Cook EB, et al. : Ann.Allergy Asthma Immunol. 2000 ; 84(5) :504-508
- 13) Yanni JM, et al. : J.Ocul.Pharmacol.Ther. 1996 ; 12(4) :389-400
- 14) アレルギー患者における血中濃度（パタノール点眼液：2006 年 7 月 26 日承認、申請資料概要ヘ-4(2)）
- 15) Momose T, et al. : CLAO J. 1997 ; 23(2) :96-99
- 16) Christensen MT, et al. : CLAO J. 1998 ; 24(4) :227-231
- 17) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：オロパタジン点眼液 0.1%「杏林」の安全性に関する資料（眼粘膜刺激性試験）
- 18) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：
オロパタジン点眼液 0.1%「杏林」の安定性試験に関する資料（配合変化試験）

2. その他の参考文献

該当資料なし

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

該当しない

2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし

XII. 備考

1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

(1) 粉碎

該当しない

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

該当しない

2. その他の関連資料

配合変化試験¹⁸⁾

オロパタジン点眼液 0.1%「杏林」と他剤の二者配合による性状、pH、浸透圧比及び含量の変化のみを記載したものです。配合による効果の変化等については検討しておりませんので、配合に際しては十分ご考慮下さい。なお、最新の電子添文の用法及び用量を含む注意事項等情報についても十分ご留意ください。

〔試験方法〕

配合前に各薬剤について試験（性状、pH、浸透圧比）を行った後、室温下でオロパタジン点眼液 0.1%「杏林」と各薬剤を等量（容積比 1:1）混合し、配合直後及び 24 時間（室温・遮光保存）後の性状、pH、浸透圧比及び含量を観察した。

〔結果〕

検体	試験項目	配合前		
オロパタジン点眼液 0.1% 「杏林」	性状	無色澄明の 水性点眼液		
	pH	7.06		
	浸透圧比	1.0		
	定量法(含量: %)	98.5～101.5		
配合製剤	試験項目	配合製剤の特性	配合直後	24 時間後
ヒアレイン点眼液 0.1%	性状	無色澄明で 粘稠性のある液	無色澄明の液	無色澄明の液
	pH	6.22	7.04	7.05
	浸透圧比	1.0	1.0	1.0
	定量法(含量: %)		100.1	99.3
フルメトン点眼液 0.1%	性状	振り混ぜるとき 白濁	振り混ぜるとき 白濁	振り混ぜるとき 白濁
	pH	7.27	7.12	7.13
	浸透圧比	1.0	1.0	1.0
	定量法(含量: %)		99.6	97.9
ニフラン点眼液 0.1%	性状	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液
	pH	7.62	7.74	7.74
	浸透圧比	1.1	1.1	1.1
	定量法(含量: %)		99.3	97.5
ジクロード点眼液 0.1%	性状	微黄色澄明の液	微黄色澄明の液	微黄色澄明の液
	pH	7.36	7.44	7.43
	浸透圧比	1.1	1.1	1.1
	定量法(含量: %)		99.8	99.5
リンデロン点眼・点耳・ 点鼻液 0.1%	性状	無色澄明の液	にごりのある液	にごりのある液
	pH	7.80	7.47	7.46
	浸透圧比	0.8	0.9	0.9
	定量法(含量: %)		99.6	98.0
点眼・点鼻用リンデロンA液	性状	微黄色澄明の液	微黄色澄明の液	微黄色澄明の液
	pH	7.00	7.00	7.00
	浸透圧比	0.7	0.9	0.8
	定量法(含量: %)		99.8	98.0

配合製剤	試験項目	配合製剤の特性	配合直後	24 時間後
プロナック点眼液 0.1%	性状	黄色澄明の液	黄色澄明の液	黄色澄明の液
	pH	8.27	8.26	8.26
	浸透圧比	1.0	1.1	1.1
	定量法(含量: %)		99.6	97.5
キサラタン点眼液 0.005%	性状	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液
	pH	6.73	6.83	6.83
	浸透圧比	0.9	1.0	1.0
	定量法(含量: %)		99.8	97.5
チモプトール点眼液 0.5%	性状	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液
	pH	6.84	6.88	6.88
	浸透圧比	1.0	1.0	1.0
	定量法(含量: %)		99.9	97.6
チモプトール XE 点眼液 0.5%	性状	無色、わずかに粘性のある液	無色、わずかに粘性のある液	無色、わずかに粘性のある液
	pH	6.94	7.04	7.01
	浸透圧比	1.0	1.0	1.0
	定量法(含量: %)		95.4	95.0
クラビット点眼液 0.5%	性状	微黄色澄明の液	微黄色澄明の液	微黄色澄明の液
	pH	6.60	6.92	6.92
	浸透圧比	1.0	1.0	1.0
	定量法(含量: %)		100.1	99.6
クラビット点眼液 1.5%	性状	黄色澄明の液	黄色澄明の液	黄色澄明の液
	pH	6.54	6.77	6.79
	浸透圧比	1.0	1.0	1.0
	定量法(含量: %)		100.1	100.2
ミケラン点眼液 2%	性状	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液
	pH	6.71	7.00	7.00
	浸透圧比	1.0	1.0	1.0
	定量法(含量: %)		99.9	98.0
ミケラン LA 点眼液 2%	性状	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液
	pH	6.62	6.98	6.98
	浸透圧比	1.0	1.0	1.0
	定量法(含量: %)		99.4	99.5